

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
22. April 2004 (22.04.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/032903 A3

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 9/16, 31/513

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/011205

(22) Internationales Anmeldedatum:  
9. Oktober 2003 (09.10.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 47 037.5 9. Oktober 2002 (09.10.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): ABBOTT GMBH & CO. KG [DE/DE]; Max-Planck-Ring 2, 65205 Wiesbaden (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ROSENBERG, Jörg [DE/DE]; Bruchstr. 29, 67158 Ellerstadt (DE). BERNDL, Gunther [DE/DE]; Am Dörrling 7, 67273 Herxheim (DE). MÄGERLEIN, Markus [DE/DE]; Eichendorffstrasse 8, 68167 Mannheim (DE).

(74) Anwälte: KINZEBACH, Werner usw.; Reitstötter, Kinzebach & Partner (GbR), Sternwartstrasse 4, 81679 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 11. November 2004

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING SOLID GALENIC FORMULATIONS USING A CROSSLINKED NON-THERMOPLASTIC CARRIER

(54) Bezeichnung: HERSTELLUNG VON FESTEN DOSIERUNGSFORMEN UNTER VERWENDUNG EINES VERNETZTEN NICHT-THERMOPLASTISCHEN TRÄGERS

(57) Abstract: The invention concerns a method for producing solid galenic formulations which consists in: forming a processable paste comprising a) 50 to 99.4 wt. % of at least one non-thermoplastic carrier, b) 0.5 to 30 wt. % of at least an adjuvant selected among thermoplastic polymers, lipids, sugar alcohols and solubilizing agents, c) 0.1 to 49.5 wt. % of at least one active principle, at a temperature not less than the softening temperature of the adjuvant but rising to at least 70 °C; then in cooling the resulting paste. Said solid galenic formulations quickly disintegrate in an aqueous medium.

(57) Zusammenfassung: Beschrieben wird ein Verfahren zur Herstellung fester Dosierungsformen, bei dem man eine formbare Masse, die a) 50 bis 99,4 Gew.-% wenigstens eines nicht-thermoplastischen Trägers, b) 0,5 bis 30 Gew.-% wenigstens eines unter thermoplastischen Polymeren, Lipiden, Zuckeralkoholen, Zuckeralkoholderivaten und Solubilisatoren ausgewählten Adjuvans und c) 0,1 bis 49,5 Gew.-% wenigstens eines Wirkstoffs umfasst, bei einer Temperatur bei 10 oder oberhalb des Erweichungspunkts des Adjuvans, mindestens jedoch 70 °C, bildet und anschließend abkühlt. Die Dosierungsformen zerfallen in wässriger Umgebung rasch.



WO 2004/032903 A3

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 IPC 7 A61K9/16 A61K31/513

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, MEDLINE, BIOSIS, EMBASE

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| Y          | EP 0 960 620 A (RANBAXY LAB LTD)<br>1 December 1999 (1999-12-01)<br>example 6   | 1-8                   |
| Y          | US 2002/012706 A1 (STERGIOS PAMELA R ET<br>AL) 31 January 2002 (2002-01-31)<br>example 6  | 1-8                   |
| Y          | GB 1 442 951 A (CASSELLA FARBWERKE MAINKUR<br>AG) 21 July 1976 (1976-07-21)<br>examples 3,5   | 1-9                   |
| Y          | WO 01 78716 A (KINOSHITA YOSHIKO ;SHIMOJO<br>FUMIO (JP); HIROSE TAKEO (JP); OIKE ATS)<br>25 October 2001 (2001-10-25)<br>example 10<br>paragraph '0036! | 1-9                   |

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*A\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 March 2004

Date of mailing of the international search report

30/03/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Sindel, U

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP 03/11205

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2. ☒ Claims Nos.: 1-2, 8-9  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:  
  
**see supplemental sheet FURTHER INFORMATIONS PCT/ISA/210**
  
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

Continuation of Box I.2

## Claims 1-2 and 8-9

The current claims 1-2 and 8-9 relate to an inordinately large number of possible methods. In fact the number of variables is such that the claims are too unclear and too broadly worded (PCT Article 6) to allow a meaningful search to be carried out. The search was therefore directed to the claims that can be considered clear, namely claims 3-7.

The applicant is advised that claims or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established cannot normally be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). In its capacity as International Preliminary Examining Authority the EPO generally will not carry out a preliminary examination for subject matter that has not been searched. This also applies to cases where the claims were amended after receipt of the international search report (PCT Article 19) or where the applicant submits new claims in the course of the procedure under PCT Chapter II.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/JP 03/11205

| Patent document<br>cited in search report |    | Publication<br>date | Patent family<br>member(s)   | Publication<br>date  |
|---|----|---------------------|--|--|
| EP 0960620                                | A  | 01-12-1999          | AU 1979699 A<br>BR 9910723 A<br>CN 1237415 A , C<br>EP 0960620 A1<br>WO 9961022 A1<br>US 2002128293 A1<br>ZA 9810765 A   | 13-12-1999<br>12-06-2001<br>08-12-1999<br>01-12-1999<br>02-12-1999<br>12-09-2002<br>06-08-1999   |
| US 2002012706                             | A1 | 31-01-2002          | US 6497905 B1<br>AU 3900300 A<br>BR 0009176 A<br>CA 2362728 A1<br>JP 2003531099 T<br>WO 0056726 A1<br>US 2002037324 A1<br>CN 1379768 T<br>EP 1163234 A1                                      | 24-12-2002<br>09-10-2000<br>18-12-2001<br>28-09-2000<br>21-10-2003<br>28-09-2000<br>28-03-2002<br>13-11-2002<br>19-12-2001   |
| GB 1442951                                | A  | 21-07-1976          | DE 2357503 A1<br>AU 7537774 A<br>BE 822320 A1<br>DD 114753 A5<br>DK 585974 A<br>FI 327174 A<br>FR 2251563 A1<br>JP 50088216 A<br>NL 7414678 A<br>NO 744056 A<br>SE 7414127 A<br>ZA 7407334 A | 28-05-1975<br>20-05-1976<br>20-05-1975<br>20-08-1975<br>14-07-1975<br>18-05-1975<br>13-06-1975<br>15-07-1975<br>21-05-1975<br>16-06-1975<br>20-05-1975<br>31-12-1975 |
| WO 0178716                                | A  | 25-10-2001          | AU 4684701 A<br>BR 0110310 A<br>CA 2407063 A1<br>EP 1275386 A1<br>HU 0300429 A2<br>WO 0178716 A1   | 30-10-2001<br>18-02-2003<br>25-10-2001<br>15-01-2003<br>28-07-2003<br>25-10-2001   |

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/03/11205

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
 IPK 7 A61K9/16 A61K31/513

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
 IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, MEDLINE, BIOSIS, EMBASE

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| Y          | EP 0 960 620 A (RANBAXY LAB LTD)<br>1. Dezember 1999 (1999-12-01)<br>Beispiel 6   | 1-8                |
| Y          | US 2002/012706 A1 (STERGIOS PAMELA R ET AL)<br>31. Januar 2002 (2002-01-31)<br>Beispiel 6   | 1-8                |
| Y          | GB 1 442 951 A (CASSELLA FARBWERKE MAINKUR AG)<br>21. Juli 1976 (1976-07-21)<br>Beispiele 3,5   | 1-9                |
| Y          | WO 01 78716 A (KINOSHITA YOSHIKO ;SHIMOJO FUMIO (JP); HIROSE TAKEO (JP); OIKE ATS)<br>25. Oktober 2001 (2001-10-25)<br>Beispiel 10<br>Absatz '0036! | 1-9                |



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

15. März 2004

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

30/03/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Sindel, U

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☒ Ansprüche Nr. 1-2, 8-9  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich  
siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210
3. ☐ Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Ansprüche Nr.: 1-2, 8-9

Die geltenden Patentansprüche 1-2 und 8-9 beziehen sich auf eine unverhältnismäßig große Zahl möglicher Verfahren. In der Tat umfassen sie so viele mögliche Veränderliche, daß sie im Sinne von Art. 6 PCT in einem solchen Maße zu unklar und weitläufig gefasst erscheinen, als daß sie eine sinnvolle Recherche ermöglichen. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, die als klar gelten können, nämlich den Inhalt der Ansprüche 3-7.

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.



# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/SA/210 03/11205

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument |    | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|----|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0960620   | A  | 01-12-1999                    | AU 1979699 A                      | 13-12-1999                    |
|  |    |                               | BR 9910723 A                      | 12-06-2001                    |
|  |    |                               | CN 1237415 A ,C                   | 08-12-1999                    |
|  |    |                               | EP 0960620 A1                     | 01-12-1999                    |
|  |    |                               | WO 9961022 A1                     | 02-12-1999                    |
|  |    |                               | US 2002128293 A1                  | 12-09-2002                    |
|  |    |                               | ZA 9810765 A                      | 06-08-1999                    |
| US 2002012706                                      | A1 | 31-01-2002                    | US 6497905 B1                     | 24-12-2002                    |
|  |    |                               | AU 3900300 A                      | 09-10-2000                    |
|  |    |                               | BR 0009176 A                      | 18-12-2001                    |
|  |    |                               | CA 2362728 A1                     | 28-09-2000                    |
|  |    |                               | JP 2003531099 T                   | 21-10-2003                    |
|  |    |                               | WO 0056726 A1                     | 28-09-2000                    |
|  |    |                               | US 2002037324 A1                  | 28-03-2002                    |
|  |    |                               | CN 1379768 T                      | 13-11-2002                    |
|  |    |                               | EP 1163234 A1                     | 19-12-2001                    |
| GB 1442951   | A  | 21-07-1976                    | DE 2357503 A1                     | 28-05-1975                    |
|  |    |                               | AU 7537774 A                      | 20-05-1976                    |
|  |    |                               | BE 822320 A1                      | 20-05-1975                    |
|  |    |                               | DD 114753 A5                      | 20-08-1975                    |
|  |    |                               | DK 585974 A                       | 14-07-1975                    |
|  |    |                               | FI 327174 A                       | 18-05-1975                    |
|  |    |                               | FR 2251563 A1                     | 13-06-1975                    |
|  |    |                               | JP 50088216 A                     | 15-07-1975                    |
|  |    |                               | NL 7414678 A                      | 21-05-1975                    |
|  |    |                               | NO 744056 A                       | 16-06-1975                    |
|  |    |                               | SE 7414127 A                      | 20-05-1975                    |
|  |    |                               | ZA 7407334 A                      | 31-12-1975                    |
| WO 0178716   | A  | 25-10-2001                    | AU 4684701 A                      | 30-10-2001                    |
|  |    |                               | BR 0110310 A                      | 18-02-2003                    |
|  |    |                               | CA 2407063 A1                     | 25-10-2001                    |
|  |    |                               | EP 1275386 A1                     | 15-01-2003                    |
|  |    |                               | HU 0300429 A2                     | 28-07-2003                    |
|  |    |                               | WO 0178716 A1                     | 25-10-2001                    |